

TITLE: Anthraquinone glycosides for the treatment of constipation

INVENTOR(S): Chicouri, Marcel; Chicouri, Isabelle

PATENT ASSIGNEE(S): Fr.

SOURCE: Fr. Demande, 8 pp.

CODEN: FRXXBL

DOCUMENT TYPE: Patent

LANGUAGE: French

FAMILY ACC. NUM. COUNT: 1

PATENT INFORMATION:

| PATENT NO. | KIND | DATE     | APPLICATION NO. | DATE         |
|------------|------|----------|-----------------|--------------|
| FR 2646352 | A1   | 19901102 | FR 1989-5688    | 19890428 <-- |
| FR 2646352 | B3   | 19910906 |                 |              |

PRIORITY APPLN. INFO.: FR 1989-5688 19890428

AB A drug for the treatment of constipation comprises a plant extract rich in anthraquinone glycosides, specifically sennosides. The drug also comprises Plantago psyllium fiber or guar gum, and prune extract. A composition comprised sennoside B 65, P. psyllium fiber 1000, prune extract 100, Et cellulose 4-5, and colloidal silica 825 g.

First Hit

L3: Entry 1 of 2

File: EPAB

Nov 2, 1990

PUB-NO: FR002646352A1

DOCUMENT-IDENTIFIER: FR 2646352 A1

TITLE: Novel pharmaceutical compositions for the treatment of constipation and process for obtaining them

PUBN-DATE: November 2, 1990

## ASSIGNEE-INFORMATION:

| NAME              | COUNTRY |
|-------------------|---------|
| CHICOURI MARCEL   | FR      |
| CHICOURI ISABELLE | FR      |

APPL-NO: FR08905688

APPL-DATE: April 28, 1989

PRIORITY-DATA: FR08905688A (April 28, 1989)

INT-CL (IPC): A61K 35/78

EUR-CL (EPC): A61K035/78

## ABSTRACT:

The invention relates to novel pharmaceutical compositions intended for human or animal therapy.

It relates to pharmaceutical compositions consisting of a mixture of extract rich in anthraquinone glucosides of vegetable origin, a mucilaginous extract consisting of psyllium and guar gum and an extract of *Prunus*, in combination or mixed with a pharmaceutically acceptable, non-toxic, inert excipient or vehicle.

The pharmaceutical compositions according to the invention are used as a medicament for the treatment of constipation.

First Hit

## End of Result Set

L3: Entry 2 of 2

File: DWPI

Nov 2, 1990

DERWENT-ACC-NO: 1990-378219

DERWENT-WEEK: 199051

COPYRIGHT 2007 DERWENT INFORMATION LTD

TITLE: New compsns. to treat constipation contain anthraquinone glucoside(s) - of vegetable origin, a mucilaginous plant prepn. and an extract of prunus

INVENTOR: CHICOURI, I ; CHICOURI, M

## PATENT-ASSIGNEE:

|            |       |
|------------|-------|
| ASSIGNEE   | CODE  |
| CHICOURI M | CHICI |

PRIORITY-DATA: 1989FR-0005688 (April 28, 1989)

## PATENT-FAMILY:

| PUB-NO   | PUB-DATE         | LANGUAGE | PAGES | MAIN-IPC |
|--|------------------|----------|-------|----------|
| <input checked="" type="checkbox"/> FR 2646352 A | November 2, 1990 |          | 000   |          |

## APPLICATION-DATA:

| PUB-NO      | APPL-DATE      | APPL-NO        | DESCRIPTOR |
|-------------|----------------|----------------|------------|
| FR 2646352A | April 28, 1989 | 1989FR-0005688 |            |

INT-CL (IPC): A61K 35/78

ABSTRACTED-PUB-NO: FR 2646352A

## BASIC-ABSTRACT:

New pharmaceutical compsns. for the treatment of constipation are claimed. Compsns. (1) contain a prepn. (a) rich in anthraquinone glucosides of vegetable origin, a mucilaginous plant prepn. (b) and an extract of Prunus (c), in association or mixed with an inert, non-toxic, pharmaceutically acceptable excipient or vehicle. Prepn. (a) = a powdered extract of senna contg. 10-90% of anthraquinone glucosides, or an almost pure mixt. of sennosides, or is chosen from extracts or powders of plants such as cascara, black alder, rhubarb or aloes. Prepn. (B) = a fine powder of Psyllium flakes or Guar gum. Extract (c) = an aq. or aq./alcoholic or dried extract of prunes. The excipient or vehicle is suitable for oral admin. The ratio (a):(b):(c) = 1:100:10-10:100:1.

ADVANTAGE - Use of compsn. (1) does not produce cramps or painful intestinal contractions. The quantity of anthraquinone glucosides is less than in the usual prepsn. so that there is less tendency to provoke a purgative effect. Sec. effects are minimised.

CHOSEN-DRAWING: Dwg. 0/0

TITLE-TERMS: NEW COMPOSITION TREAT CONSTIPATION CONTAIN ANTHRAQUINONE GLUCOSIDE  
VEGETABLE ORIGIN MUCILAGE PLANT PREPARATION EXTRACT PRUNUS

DERWENT-CLASS: B04 B05

CPI-CODES: B04-A07F; B10-A06; B12-J07;

CHEMICAL-CODES:

Chemical Indexing M1 \*01\*  
Fragmentation Code  
M423 M431 M782 M903 P737 V400 V406  
Registry Numbers  
1327U 0502U

Chemical Indexing M2 \*02\*

Fragmentation Code  
F012 F013 F014 F015 F016 F019 F123 F199 G020 G022  
G029 G332 G399 H4 H405 H424 H442 H482 H5 H522  
H8 J0 J012 J1 J132 J5 J562 K0 L8 L814  
L819 L821 L831 M1 M125 M129 M141 M149 M280 M311  
M322 M342 M373 M392 M413 M431 M510 M522 M532 M540  
M782 M903 M904 P737  
Specfic Compounds  
13909M 15413M  
Registry Numbers  
1327U 0502U

SECONDARY-ACC-NO:

CPI Secondary Accession Numbers: C1990-164742

(19) RÉPUBLIQUE FRANÇAISE  
INSTITUT NATIONAL  
DE LA PROPRIÉTÉ INDUSTRIELLE  
PARIS

(11) N° de publication :  
(à utiliser que pour les  
commandes de reproduction)

**2 646 352**

(21) N° d'enregistrement national :

**89 05688**

(51) Int Cl<sup>s</sup> : A 61 K 35/78.

(12)

## DEMANDE DE BREVET D'INVENTION

A1

(22) Date de dépôt : 28 avril 1989.

(71) Demandeur(s) : CHICOURI Marcel et CHICOURI Isabelle.  
— FR.

(30) Priorité :

(43) Date de la mise à disposition du public de la  
demande : BOPI « Brevets » n° 44 du 2 novembre 1990.

(72) Inventeur(s) : Marcel Chicouri ; Isabelle Chicouri.

(60) Références à d'autres documents nationaux appa-  
rentés :

(73) Titulaire(s) :

(74) Mandataire(s) : Cabinet Gefib.

(54) Nouvelles compositions pharmaceutiques pour le traitement de la constipation et leur procédé d'obtention.

(57) L'invention se rapporte à de nouvelles compositions phar-  
maceutiques destinées à la thérapeutique humaine ou animale.

Elle est caractérisée en ce qu'elle concerne des composi-  
tions pharmaceutiques constituées par un mélange d'extrait  
riche en glucosides anthraquinoniques d'origine végétale, un  
extrait mucilagineux choisi dans le groupe constitué par le  
Psyllium et la Gomme Guar et un extrait de Prunus, en  
association ou en mélange avec un excipient ou un véhicule  
inerte, non toxique, pharmaceutiquement acceptable.

Les compositions pharmaceutiques selon l'invention servent  
de médicament pour le traitement de la constipation.

FR 2 646 352 - A1

D

- 1 -

NOUVELLES COMPOSITIONS PHARMACEUTIQUES  
POUR LE TRAITEMENT DE LA CONSTIPATION  
ET LEUR PROCEDE D'OBTENTION

5 La présente invention concerne des compositions pharmaceutiques nouvelles destinées au traitement de la constipation chronique ou occasionnelle.

10 Elle a plus particulièrement pour objet de nouvelles compositions pharmaceutiques renfermant à titre de principes actifs une préparation riche en glucosides anthraquinoniques, d'origine végétale, une plante mucilagineuse et un extrait de *Prunus*. Ces trois principes actifs ont des actions différentes s'exerçant à différents niveaux du tube digestif en se renforçant 15 réciproquement.

20 L'invention a spécifiquement pour objet une composition pharmaceutique à visée laxative, caractérisée en ce qu'elle renferme une poudre végétale riche en glucosides anthraquinoniques, un extrait mucilagineux choisi dans le groupe constitué par la poudre de téguments de *Psyllium* et la gomme guar ainsi qu'un extrait de pruneaux, en mélange ou en addition avec un excipient ou un véhicule inerte non toxique pharmaceutiquement acceptable destiné à la voie orale.

25 Dans un mode d'exécution préféré de l'invention, la poudre végétale riche en glucosides anthraquinoniques est un extrait de feuilles de sené pulvérulent contenant notamment de 10 à 90 % de glucosides anthraquinoniques.

30 On peut également utiliser des glucosides anthraquinoniques à l'état essentiellement pur à la place de poudres végétales. La poudre d'origine végétale riche en glucosides anthraquinoniques peut être également une poudre ou un extrait pulvérulent d'autres plantes comme celui de Cascara, de Bourdaine, de Rhapontic d'Aloes 35 ou de Rhubarbe, dont la teneur en dérivés anthraquinoniques a été déterminée au préalable.

- 2 -

La préparation de plante mucilagineuse est de préférence une poudre très fine ou micronisée de téguments de psyllium ou de la gomme guar micronisée de manière à obtenir une forme pulvérulente particulièrement fine et aisément mélangeable aux autres constituants de la préparation pharmaceutique.

L'extrait de pruneaux est un extrait fluide ou sec résultant de l'épuisement par l'eau ou par un mélange hydroalcoolique à température ordinaire ou à chaud de pruneaux notamment par macération ou digestion. L'extrait ainsi obtenu est concentré sous vide jusqu'à consistance visqueuse ou jusqu'à siccité. On préfère utiliser une préparation pulvérulente dont l'incorporation sera faite, sans problème.

Les compositions pharmaceutiques selon l'invention sont présentées sous l'une des formes convenant pour l'administration par voie orale et notamment sous forme de gélules, de sachets, de poudres, sous forme de capsules molles ou dures, sous forme de granulés.

Les excipients inertes appropriés seront par exemple des amidons, des dérivés chimiques d'amidons comme le carboxyméthylamidon et ses sels, la cellulose microcristalline, les alcoyl celluloses, la carboxy méthylcellulose, la croscarmellose et ses sels, le carbonate de calcium, le phosphate tricalcique ou le phosphate de magnésium.

Comme véhicule approprié, on utilisera l'eau et le glycerol ou l'eau, l'éthanol et le glycérol de manière à réaliser une solution aqueuse ou éthanolique de viscosité élevée.

Les rapports pondéraux entre les différents composants pourront varier largement entre des proportions de 1:100:10 à 10:100:1, c'est-à-dire s'échelonnant de 1 partie d'extrait végétal de glucosides anthraquinoniques, pour 100 parties de poudre de mucilage et 10 parties d'extrait de pruneaux à 1 partie d'extrait de poudre végétale riche en glucosides anthraquinoniques, 100 parties de poudre de mucilage et 1 partie d'extrait sec de pruneaux.

- 3 -

La formulation préférée contient notamment :

- extrait de feuilles de séné titrée en  
sennosides correspondant à ..... 7.5 mg de glucosides

5

- poudre de teguments de psyllium ou  
poudre micronisée de gomme guar ..... 250 mg

- extrait sec de pruneaux ..... 25 mg

10

L'excipient pour une forme solide est de préférence une poudre non hygroscopique comme le Carbonate de Calcium, le carbonate de Magnésium, le phosphate tricalcique, la silice, l'Alumine, la cellulose ou un mélange de plusieurs de ces constituants.

15

Si la composition est une préparation liquide, on utilisera de préférence une solution ou suspension des principes actifs dans un solvant non polaire très visqueux comme le propylène glycol, le dipropylène glycol ou le trihydroxy propane. Des mélanges de solvants peuvent être envisagés, et il est utile d'y ajouter une quantité d'eau suffisante pour que la viscosité de la solution soit dans des zones qui permettent l'ingestion d'une solution.

20  
25 Les compositions selon l'invention trouvent un emploi pour traiter les effets de la constipation. L'administration du mélange, selon l'invention, permet la survenue d'un effet complet et plus rapide.

La posologie utilitaire est de 1 à 4 sachets par jour en suivant les recommandations du médecin traitant.

30

Cet effet laxatif se manifeste sans risque de crampes ou de contractions intestinales douloureuses. En outre, les compositions selon l'invention renferment une quantité de glucosides anthraquinoniques sensiblement moindre que les préparations usuelles et ainsi, sont moins susceptibles de provoquer un effet purgatif. On obtient ainsi des compositions laxatives manifestant le minimum d'effets secondaires.

- 4 -

Les exemples suivants illustrent l'invention :

EXEMPLE 1

Sachets de poudre

5

- . Sennosides B ..... 65 g
- . Poudre de téguments de Psyllium ..... 1000 g
- . Extrait de pruneaux ..... 100 g
- . Ethyl cellulose ..... 4 à 5 g
- 10 . Silice colloïdale ..... 825 g

10

On mélange très soigneusement lesdits constituants en ajoutant successivement aux sennosides B, l'extrait de pruneaux puis la poudre de téguments de Psyllium. Après homogénéisation complète, 15 on ajoute l'éthyl cellulose puis la silice colloïdale. Le mélange est ensuite réparti en 1000 sachets renfermant 2 g de mélange.

EXEMPLE 2

Sachets de poudre

20

- . Extrait sec de sené titré à 20 %  
en sennosides A & B ..... 400 g
- . Poudre de gomme Guar micronisée ..... 850 g
- . Extrait de pruneaux ..... 150 g
- 25 . Carbonate de Calcium léger ..... 1000 g

pour 100 sachets.

EXEMPLE 3

Gélules de mélange

- . Sennosides B ..... 75 g
- . Gomme Guar micronisée ..... 400 g
- . Extrait de pruneaux ..... 125 g
- 35 . Cellulose microcristalline ..... 200 g

pour 1000 gélules terminées à 0,800 g

- 5 -

EXEMPLE 4

Sachets de poudre

|    |  |        |
|----|--|--------|
|    | Extrait de feuilles de sené titrant 40 %                     |        |
| 5  | en sennosides .....  | 200 g  |
|    | Gomme Guar micronisée .....                                  | 1000 g |
|    | Extrait sec de pruneaux .....                                | 120 g  |
|    | Polymère d'oxyde d'éthylène et<br>d'oxyde de propylène ..... | 40 g   |
| 10 | (vendu sous la marque PLURONIC F.18)                         |        |
|    | Cellulose microcristalline .....                             | 2640 g |

pour 1000 sachets

15

20

25

30

35

- 6 -

R E V E N D I C A T I O N S

L'invention a pour objet :

- 5        1°- De nouvelles compositions pharmaceutiques destinées au traitement de la constipation caractérisées en ce qu'elles renferment à titre de principes actifs, une préparation riche en glucosides anthraquinoniques, d'origine végétale, une préparation de plante mucilagineuse et un extrait de prunus, en association ou en mélange avec un excipient ou véhicule inerte non toxique, pharmaceutiquement-acceptable.
- 10      2°- Une composition pharmaceutique selon la revendication 1° dans laquelle, la préparation riche en glucosides anthraquinoniques est un extrait de sené pulvérulent.
- 15      3°- Une composition pharmaceutique selon l'une des revendications 1 ou 2° dans laquelle, l'extrait de sené pulvérulent renferme de 10 à 90 % de glucosides anthraquinoniques.
- 20      4°- Une composition pharmaceutique selon l'une des revendications 1 ou 2° dans laquelle, la préparation riche en glucosides anthraquinoniques est constituée par un mélange de sennosides pratiquement purs.
- 25      5°- Une composition pharmaceutique selon la revendication 1° dans laquelle, la poudre riche en glucosides anthraquinoniques est choisie parmi les extraits ou les poudres de plantes comme le Cascara, la Bourdaine, le Rhapsode, l'Aloès et la Rhubarbe.
- 30      6°- Une composition pharmaceutique selon la revendication 1° dans laquelle, la préparation de plante mucilagineuse est une préparation pulvérulente très fine de téguments de psyllium ou de gomme Guar.
- 35      7°- Une composition pharmaceutique selon la revendication 1° dans laquelle, l'extrait de Prunus est un extrait aqueux ou hydroalcoolique fluide ou sec de pruneaux.

- 7 -

- 8°- Une composition pharmaceutique selon l'une des revendications précédentes dans laquelle, l'excipient ou le véhicule est un de ceux qui conviennent pour l'administration par voie orale.
- 5      9°- Une composition pharmaceutique selon l'une des revendications précédentes dans laquelle, le rapport pondéral des différents principes actifs varie de 1:100:10 à 10:100:1 respectivement pour l'extrait de glucosides anthraquinoniques, la poudre de mucilage et l'extrait de prunus.
- 10     10°- Une composition pharmaceutique selon l'une des revendications précédentes caractérisée en ce qu'elle renferme 6,5 mg de sennosides, 1 g de poudre de téguments de psyllium et 0,10 g d'extrait de Prunus par prise unitaire.
- 15
- 20
- 25
- 30
- 35